

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第3区分

【発行日】平成30年8月9日(2018.8.9)

【公表番号】特表2017-526767(P2017-526767A)

【公表日】平成29年9月14日(2017.9.14)

【年通号数】公開・登録公報2017-035

【出願番号】特願2017-501288(P2017-501288)

【国際特許分類】

C 0 8 G 73/06 (2006.01)

C 0 7 D 211/26 (2006.01)

A 6 1 K 31/787 (2006.01)

A 6 1 K 31/4465 (2006.01)

A 6 1 K 31/785 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

C 0 8 G 12/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 8 G 73/06

C 0 7 D 211/26

A 6 1 K 31/787

A 6 1 K 31/4465

A 6 1 K 31/785

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 19/04

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 11/00

C 0 8 G 12/06

【手続補正書】

【提出日】平成30年6月26日(2018.6.26)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

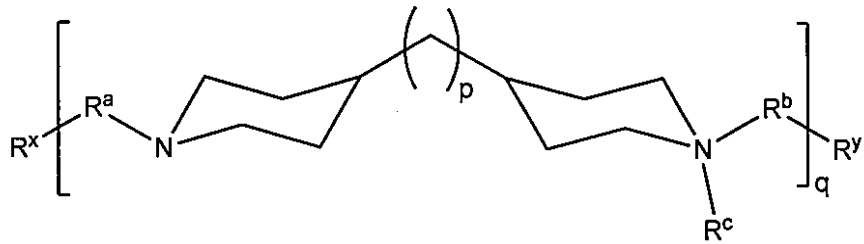
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の構造を含む化合物

【化1】



(I)

[式中、

p は、0、1、2、3、または4であり、

q は、2 ~ 10, 000の整数であり；

R^a および R^b は、それぞれ独立に、不在であり、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換もしくは非置換の基であり；

R^c は、H、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換もしくは非置換の基であり；

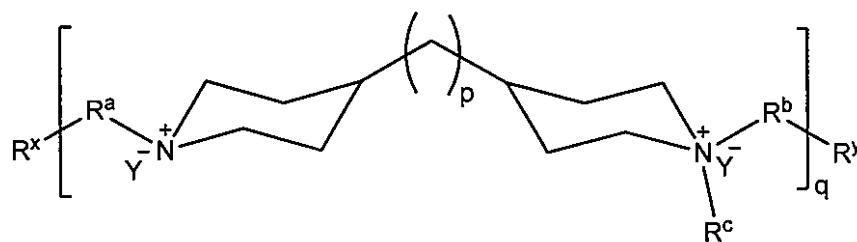
R^x および R^y は、それぞれ独立に、薬学的に許容される末端基であり、またはこれらが結合している炭素と一緒に、3 ~ 10員の環を形成し、

ここで、該3 ~ 10員の環は、場合により、ポリマーに結合され、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される1 ~ 4個の基で置換される]、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項2】

式(III)の構造を含む化合物

【化2】



(III)

[式中、

p は、0、1、2、3、または4であり、

q は、2 ~ 10, 000 の整数であり；

R^a および R^b は、それぞれ独立に、不在であり、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換もしくは非置換の基であり；

R^c は、H、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換もしくは非置換の基であり；

R^x および R^y は、それぞれ独立に、薬学的に許容される末端基であり、またはこれらが結合している炭素と一緒に、3 ~ 10 員の環を形成し、

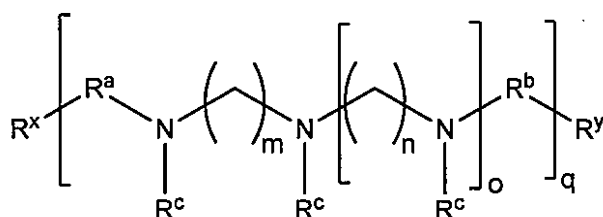
ここで、該 3 ~ 10 員の環は、場合により、ポリマーに結合され、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される 1 ~ 4 個の基で置換され、

Y⁻ はそれぞれ独立に、八口または任意の薬学的に許容されるアニオンである]、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 3】

式 (IV) の構造を含む化合物

【化 3】



(IV)

[式中、

m は 0 ~ 15 の整数であり；

n は 0 ~ 15 の整数であり；

o は 0 ~ 10 の整数であり；

q は 2 ~ 10, 000 の整数であり；

R^a および R^b は、それぞれ独立に、不在であり、または置換または非置換の (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換または非置換の基であり；

R^c はそれぞれ独立に、H、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(

(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換または非置換の基であり；

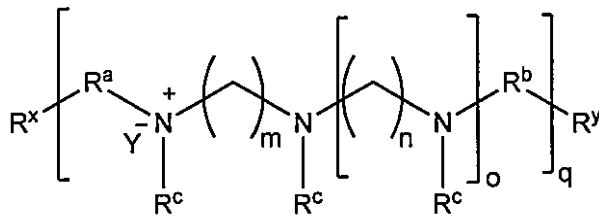
R^x および R^y は、それぞれ独立に、薬学的に許容される末端基であり、またはこれらが結合している炭素と一緒にあって、3 ~ 10 員の環を形成し、

ここで、該 3 ~ 10 員の環は、場合により、ポリマーに結合されており、または(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される 1 ~ 4 個の基で置換されている]、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 4】

式 (VI) の構造を含む化合物

【化 4】



(VI)

[式中、

m は 0 ~ 15 の整数であり；

n は 0 ~ 15 の整数であり；

o は 0 ~ 10 の整数であり；

q は 2 ~ 10, 000 の整数であり；

R^a および R^b は、それぞれ独立に、不在であり、または置換または非置換の(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換または非置換の基であり；

R^c はそれぞれ独立に、H、または(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換または非置換の基であり；

R^x および R^y は、それぞれ独立に、薬学的に許容される末端基であり、またはこれらが結合している炭素と一緒にあって、3 ~ 10 員の環を形成し、

ここで、該 3 ~ 10 員の環は、場合により、ポリマーに結合されており、または(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~

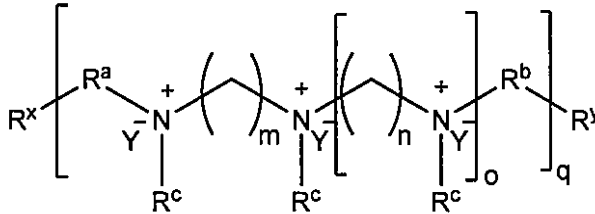
C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル - COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル - COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される1~4個の基で置換されており；

Y⁻ は、八口または任意の薬学的に許容されるアニオンである]、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項5】

式(X)の構造を含む化合物

【化5】



(X)

[式中、

mは0~15の整数であり；

nは0~15の整数であり；

oは0~10の整数であり；

qは2~10, 000の整数であり；

R^aおよびR^bは、それぞれ独立に、不在であり、または置換または非置換の(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル - COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル - COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換または非置換の基であり；

R^cはそれぞれ独立に、H、または(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル - COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル - COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換または非置換の基であり；

R^xおよびR^yは、それぞれ独立に、薬学的に許容される末端基であり、またはこれらが結合している炭素と一緒に、3~10員の環を形成し、

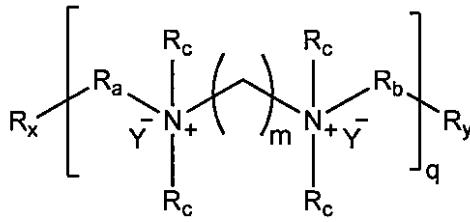
ここで、該3~10員の環は、場合により、ポリマーに結合されており、または(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル - COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル - COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される1~4個の基で置換されており；

Y⁻はそれぞれ独立に、八口または任意の薬学的に許容されるアニオンである]、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項6】

式(XI)の構造を含む化合物

【化6】



(XI)

[式中、

m は 0 ~ 15 の整数であり；

q は 2 ~ 10, 000 の整数であり；

R^a および R^b は、それぞれ独立に、不在であり、または置換または非置換の (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換または非置換の基であり；

R^c はそれぞれ独立に、H、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換または非置換の基であり；

R^x および R^y は、それぞれ独立に、薬学的に許容される末端基であり、またはこれらが結合している炭素と一緒に、3 ~ 10 員の環を形成し、

ここで、該 3 ~ 10 員の環は、場合により、ポリマーに結合されており、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Y⁻ はそれぞれ独立に、八員または任意の薬学的に許容されるアニオンである]、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項7】

請求項1に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項8】

請求項3に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項9】

粘膜炎、口腔粘膜炎、および感染症から選択される状態の治療または予防に使用するための、請求項1に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項10】

粘膜炎、口腔粘膜炎、および感染症から選択される状態の治療または予防に使用するための、請求項3に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項11】

粘膜炎、口腔粘膜炎、および感染症から選択される状態の治療または予防に使用するた

めの、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

粘膜炎、口腔粘膜炎、および感染症から選択される状態の治療または予防に使用するための、請求項 1 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

請求項 1 に記載の化合物を投与する工程を含む、粘膜炎、口腔粘膜炎、および感染症から選択される状態を治療する方法。

【請求項 1 4】

請求項 3 に記載の化合物を投与する工程を含む、粘膜炎、口腔粘膜炎、および感染症から選択される状態を治療する方法。

【請求項 1 5】

感染症は、手術部位感染症または嚢胞性線維症に関連する肺感染症である、請求項 1 3 に記載の方法。

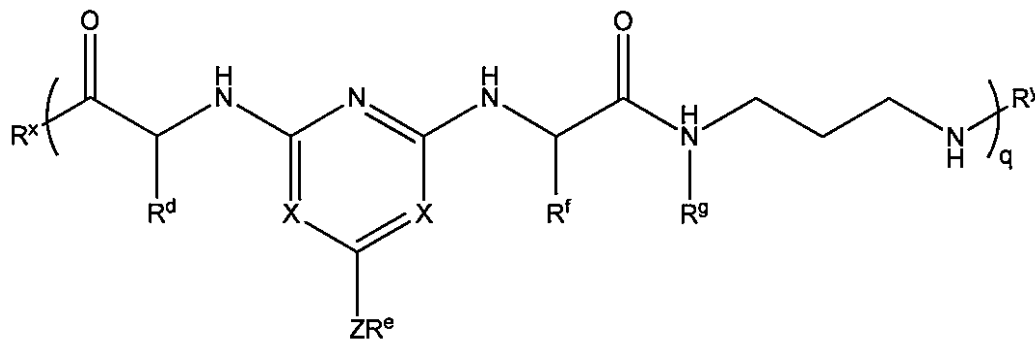
【請求項 1 6】

感染症は、手術部位感染症または嚢胞性線維症に関連する肺感染症である、請求項 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 7】

式 (X I I) の構造を含む化合物

【化 7】



(XII)

[式中、

q は 2 ~ 10 , 0 0 0 の整数であり ;

X はそれぞれ独立に、N または P であり ;

Z は、NH、O、または S であり ;

R^d および R^e は、それぞれ独立に、H、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換もしくは非置換の基であり ;

R^f および R^g は、それぞれ独立に、H、もしくは (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、-O(O)C-(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル-COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択される置換もしくは非置換の基であり、または R^f および R^g は、これらが結合している原子と一緒に 4 ~ 10 員の環を形成し、

ここで、該 4 ~ 10 員の環は、(C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆

~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、(C₁ ~ C₁₀) アルキル - C(O)O -、COOH - (C₁ ~ C₁₀) アルキル、COOH - (C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル - O -、- OH、- NH₂ から選択される 1 ~ 3 個の基で場合により置換されており;

R^x および R^y は、それぞれ独立に、薬学的に許容される末端基であり、またはこれらが結合している炭素と一緒に、3 ~ 10 員の環を形成し、

ここで、該 3 ~ 10 員の環は、場合により、ポリマーに結合されており、または (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロアルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₂ ~ C₉) ヘテロシクロアルキル、(C₆ ~ C₁₄) アリール、(C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、(C₁ ~ C₁₀) アルキルアミン、カルボニル、- O(O)C - (C₁ ~ C₁₀) アルキル、(C₁ ~ C₁₀) アルキル - COOH、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル - COOH、- (O)CH₃、- OH、アミドから選択される 1 ~ 4 個の基で置換されている]、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 18】

請求項 17 に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 19】

粘膜炎、口腔粘膜炎、および感染症から選択される状態の治療または予防に使用するための、請求項 18 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

請求項 17 に記載の化合物を投与する工程を含む、粘膜炎、口腔粘膜炎、および感染症から選択される状態を治療する方法。

【請求項 21】

感染症は、手術部位感染症または嚢胞性線維症に関連する肺感染症である、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 22】

感染症は、緑膿菌肺感染症である、請求項 21 に記載の方法。

【請求項 23】

バイオフィルムが緑膿菌肺感染症に存在する、請求項 22 に記載の方法。